

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

18 OCT 2004

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
6. November 2003 (06.11.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer

WO 03/091240 A1

not Sk

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 333/38, A01N 43/10

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP03/03894

(22) Internationales Anmeldedatum:
15. April 2003 (15.04.2003)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102 18 231.0 24. April 2002 (24.04.2002) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESSELLSCHAFT [DE/DE]; Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): DUNKEL, Ralf [DE/DE]; Krischerstr. 22, 40789 Monheim (DE). RIECK, Heiko [DE/FR]; 14 20 rue Pierre Baizet, F-69009 Lyon (FR). ELBE, Hans-Ludwig [DE/DE]; Dasnöckel 59, 42329 Wuppertal (DE). WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike [DE/DE]; Oberer Markenweg 85, 56566 Neuwied (DE). MAULER-MACHNIK, Astrid [DE/DE]; Neuenkamper Weg 48, 42799 Leichlingen (DE). KUCK, Karl-Heinz [DE/DE]; Pastor-Löh-Str. 30a, 40764 Langenfeld (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESSELLSCHAFT; Law and Patents, Patents and Licensing, 51368 Leverkusen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

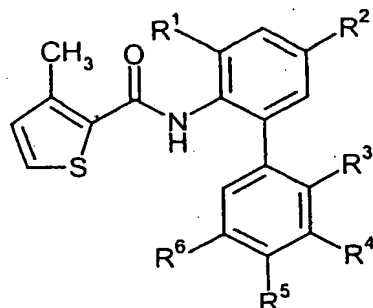
Erklärungen gemäß Regel 4.17:

— hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die folgenden Bestimmungsstaaten AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW, ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: METHYLTHIOPHENE CARBOXANILIDES

(54) Bezeichnung: METHYLTHIOPHENCARBOXANILIDE



(I)

(57) Abstract: The invention relates to novel methylthiophene carboxanilides of formula (I) wherein R¹, R², R³, R⁴, R⁵ and R⁶ have the designations cited in the description, to a plurality of methods for producing said substances, and to the use of the same for controlling undesired micro-organisms. The invention also relates to novel intermediate products and the production of the same.

(57) Zusammenfassung: Neue Methylthiophencarboxanilide der Formel (I), in welcher R¹, R², R³, R⁴, R⁵ und R⁶ die in der

Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben, mehrere Verfahren zum Herstellen dieser Stoffe und deren Verwendung zum Bekämpfen von unerwünschten Mikroorganismen, sowie neue Zwischenprodukte und deren Herstellung.

WO 03/091240 A1



- hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, die Priorität einer früheren Anmeldung zu beanspruchen (Regel 4.17 Ziffer iii) für alle Bestimmungsstaaten

Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Int. Application No.

PCT/03/03894

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 7 C07D333/38 A01N43/10

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
IPC 7 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, BIOSIS, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
------------	--	-----------------------

X

WHITE, G. A. ET AL: "Thiophene
carboxamide fungicides: structure-activity
relationships with the succinate
dehydrogenase complex from wild-type and
carboxin-resistant mutant strains of
Ustilago maydis"
PESTICIDE BIOCHEMISTRY AND PHYSIOLOGY
(1980), 14(1), 26-40 ,
XP009016749
the whole document (see also page 28,
Table 1, example XXXI)

1-9

-/--

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents:

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

T later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

X document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

Y document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

& document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

4 September 2003

Date of mailing of the international search report

30/09/2003

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Papathoma, S

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Int. Application No.
PCT/EP 03/03894

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WHITE, G. A. ET AL: "Thiophene carboxamide fungicides: structure-activity relationships with the succinate dehydrogenase complex from wild-type and carboxin-resistant mutant strains of <i>Aspergillus nidulans</i> " PESTICIDE BIOCHEMISTRY AND PHYSIOLOGY (1986), 25(2), 188-204 , XP009016748 the whole document (see also page 189, Table 1, example XXIV)	1-9
X	US 5 438 070 A (EICKEN KARL ET AL) 1 August 1995 (1995-08-01) abstract column 1 -column 4 column 14, line 34; table C column 23, line 62; example 32; table 1	1-9
X	WO 02 08197 A (MAULER MACHNIK ASTRID ;DUNKEL RALF (DE); KUGLER MARTIN (DE); RIECK) 31 January 2002 (2002-01-31) abstract page 1 -page 64; claims 1-18 page 76; examples 47,48; table 1 page 93 -page 97; examples I-47; table A page 98 -page 102; examples I-47; table B page 103 -page 107; examples I-47; table C	1-9
X	WO 93 11097 A (DU PONT) 10 June 1993 (1993-06-10) abstract page 1 -page 15; claims 1-9 page 35; table 1 page 60; example 50; table 7 Test B: Seiten 78/80 und 98/100, table B	1-9
X	US 6 369 093 B1 (MAULER-MACHNIK ASTRID ET AL) 9 April 2002 (2002-04-09) the whole document	1-9
X	EP 0 741 131 A (CENTRAL GLASS CO LTD) 6 November 1996 (1996-11-06) page 42; example 78; table 13	1-9

INTERNATIONAL RECHERCHENBERICHT

Int. Aktenzeichen

PCT/EP 03/03894

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
IPK 7 C07D333/38 A01N43/10

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 C07D A01N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, BIOSIS, CHEM ABS Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WHITE, G. A. ET AL: "Thiophene carboxamide fungicides: structure-activity relationships with the succinate dehydrogenase complex from wild-type and carboxin-resistant mutant strains of Ustilago maydis" PESTICIDE BIOCHEMISTRY AND PHYSIOLOGY (1980), 14(1), 26-40 , XP009016749 the whole document (see also page 28, Table 1, example XXXI) --- -/-	1-9

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

E älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

L Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

O Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

P Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

T Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

X Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

Y Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

Z Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

4. September 2003

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

30/09/2003

Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Papathoma, S

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

Application No

PCT/EP 03/03894

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 5438070	A	01-08-1995	DE 4231517 A1	24-03-1994
			AT 219771 T	15-07-2002
			AU 669732 B2	20-06-1996
			AU 4742293 A	31-03-1994
			CA 2105503 A1	22-03-1994
			DE 59310290 D1	01-08-2002
			DK 589301 T3	22-07-2002
			EP 0589301 A1	30-03-1994
			ES 2179047 T3	16-01-2003
			HU 68762 A2	28-07-1995
			IL 106849 A	28-01-2001
			JP 6199803 A	19-07-1994
			NZ 248694 A	28-03-1995
			PT 589301 T	29-11-2002
WO 0208197	A	31-01-2002	DE 10122447 A1	18-04-2002
			AU 7848001 A	05-02-2002
			BR 0112676 A	24-06-2003
			WO 0208197 A1	31-01-2002
			EP 1305292 A1	02-05-2003
WO 9311097	A	10-06-1993	AT 138365 T	15-06-1996
			AU 3226993 A	28-06-1993
			CN 1072562 A	02-06-1993
			DE 69211015 D1	27-06-1996
			DE 69211015 T2	09-01-1997
			EP 0619804 A1	19-10-1994
			MX 9206852 A1	01-05-1993
			WO 9311097 A1	10-06-1993
			ZA 9209220 A	27-05-1994
US 6369093	B1	09-04-2002	DE 19840322 A1	09-03-2000
			AU 5970399 A	27-03-2000
			BR 9913383 A	22-05-2001
			CN 1356985 T	03-07-2002
			WO 0014071 A2	16-03-2000
			EP 1161420 A2	12-12-2001
			JP 2002524449 T	06-08-2002
			PL 346867 A1	11-03-2002
			ZA 200101171 A	12-02-2002
EP 0741131	A	06-11-1996	AU 681233 B2	21-08-1997
			AU 1465995 A	08-08-1995
			EP 0741131 A1	06-11-1996
			JP 3041957 B2	15-05-2000
			US 5801122 A	01-09-1998
			CA 2181488 A1	27-07-1995
			WO 9519962 A1	27-07-1995
			US 6337417 B1	08-01-2002

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WHITE, G. A. ET AL: "Thiophene carboxamide fungicides: structure-activity relationships with the succinate dehydrogenase complex from wild-type and carboxin-resistant mutant strains of <i>Aspergillus nidulans</i> " PESTICIDE BIOCHEMISTRY AND PHYSIOLOGY (1986), 25(2), 188-204 , XP009016748 the whole document (see also page 189, Table 1, example XXIV)	1-9
X	US 5 438 070 A (EICKEN KARL ET AL) 1. August 1995 (1995-08-01) Zusammenfassung Spalte 1 -Spalte 4 Spalte 14, Zeile 34; Tabelle C Spalte 23, Zeile 62; Beispiel 32; Tabelle 1	1-9
X	WO 02 08197 A (MAULER MACHNIK ASTRID ;DUNKEL RALF (DE); KUGLER MARTIN (DE); RIECK) 31. Januar 2002 (2002-01-31) Zusammenfassung Seite 1 -Seite 64; Ansprüche 1-18 Seite 76; Beispiele 47,48; Tabelle 1 Seite 93 -Seite 97; Beispiele I-47; Tabelle A Seite 98 -Seite 102; Beispiele I-47; Tabelle B Seite 103 -Seite 107; Beispiele I-47; Tabelle C	1-9
X	WO 93 11097 A (DU PONT) 10. Juni 1993 (1993-06-10) Zusammenfassung Seite 1 -Seite 15; Ansprüche 1-9 Seite 35; Tabelle 1 Seite 60; Beispiel 50; Tabelle 7 Test B: Seiten 78/80 und 98/100, Tabelle B	1-9
X	US 6 369 093 B1 (MAULER-MACHNIK ASTRID ET AL) 9. April 2002 (2002-04-09) das ganze Dokument	1-9
X	EP 0 741 131 A (CENTRAL GLASS CO LTD) 6. November 1996 (1996-11-06) Seite 42; Beispiel 78; Tabelle 13	1-9

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichung zur selben Patentfamilie gehören

In les Aktenzeichen

PCT/EP 03/03894

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
US 5438070	A	01-08-1995	DE 4231517 A1	24-03-1994
			AT 219771 T	15-07-2002
			AU 669732 B2	20-06-1996
			AU 4742293 A	31-03-1994
			CA 2105503 A1	22-03-1994
			DE 59310290 D1	01-08-2002
			DK 589301 T3	22-07-2002
			EP 0589301 A1	30-03-1994
			ES 2179047 T3	16-01-2003
			HU 68762 A2	28-07-1995
			IL 106849 A	28-01-2001
			JP 6199803 A	19-07-1994
			NZ 248694 A	28-03-1995
			PT 589301 T	29-11-2002
WO 0208197	A	31-01-2002	DE 10122447 A1	18-04-2002
			AU 7848001 A	05-02-2002
			BR 0112676 A	24-06-2003
			WO 0208197 A1	31-01-2002
			EP 1305292 A1	02-05-2003
WO 9311097	A	10-06-1993	AT 138365 T	15-06-1996
			AU 3226993 A	28-06-1993
			CN 1072562 A	02-06-1993
			DE 69211015 D1	27-06-1996
			DE 69211015 T2	09-01-1997
			EP 0619804 A1	19-10-1994
			MX 9206852 A1	01-05-1993
			WO 9311097 A1	10-06-1993
			ZA 9209220 A	27-05-1994
US 6369093	B1	09-04-2002	DE 19840322 A1	09-03-2000
			AU 5970399 A	27-03-2000
			BR 9913383 A	22-05-2001
			CN 1356985 T	03-07-2002
			WO 0014071 A2	16-03-2000
			EP 1161420 A2	12-12-2001
			JP 2002524449 T	06-08-2002
			PL 346867 A1	11-03-2002
			ZA 200101171 A	12-02-2002
EP 0741131	A	06-11-1996	AU 681233 B2	21-08-1997
			AU 1465995 A	08-08-1995
			EP 0741131 A1	06-11-1996
			JP 3041957 B2	15-05-2000
			US 5801122 A	01-09-1998
			CA 2181488 A1	27-07-1995
			WO 9519962 A1	27-07-1995
			US 6337417 B1	08-01-2002